

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



30 DEC 2004

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
15. Januar 2004 (15.01.2004)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 2004/004729 A1

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: A61K 31/496,  
A61P 25/00, C07D 333/70, 307/85, 345/00, 209/42, C07F  
17/02

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2003/007060

(22) Internationales Anmeldedatum:  
2. Juli 2003 (02.07.2003)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
102 30 062.3 4. Juli 2002 (04.07.2002) DE  
102 32 020.9 10. Juli 2002 (10.07.2002) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von  
US): FRIEDRICH-ALEXANDER-UNI VERSITÄT

ERLANGEN-NÜRNBERG [DE/DE]; Schlossplatz 4,  
91054 Erlangen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): GMEINER, Peter  
[DE/DE]; Sebalder Forstweg 24, 91054 Erlangen-Buck-  
enhof (DE). HÜBNER, Harald [DE/DE]; Reuendorfer  
Weg 7, 91336 Heroldsbach (DE). SCHLOTTER, Karin  
[DE/DE]; Spitalgasse 5, 86732 Oettingen (DE).

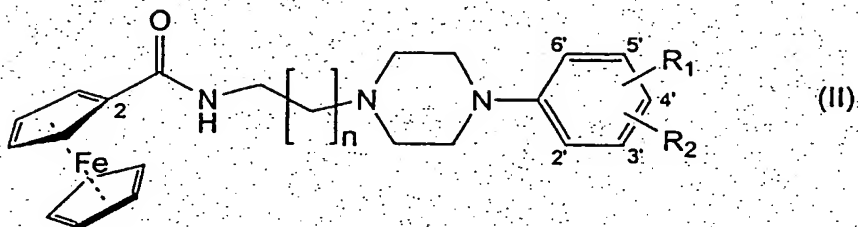
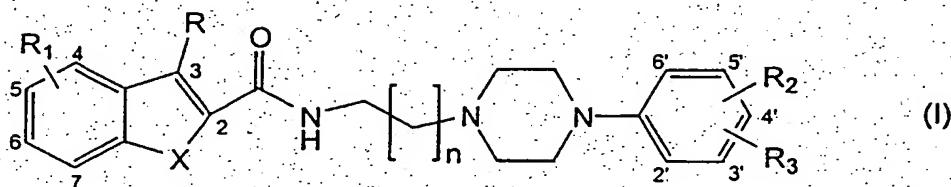
(74) Anwalt: HOFFMANN EITLE; Arabellastrasse 4, 81925  
München (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT,  
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,  
CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE,  
GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR,  
KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: UTILIZATION OF HETEROARENE CARBOXAMIDE AS DOPAMINE-D3 LIGANDS FOR THE TREATMENT OF  
CNS DISEASES

(54) Bezeichnung: HETEROAREN-CARBOXAMIDE ZUR VERWENDUNG ALS DOPAMIN-D3 LIGANDEN ZUR BEHAND-  
LUNG VON ZNS-ERKRANKUNGEN



(57) Abstract: The invention relates to neuroreceptor active N-[(4-phenyl-1-piperazinyl)alkyl]-substituted heteroarene carboxam-  
ide of general formula (I) and to structure analogous 2-ferrocenyl compounds of general formula (II) and the utilization thereof  
for the treatment of CNS diseases, for example, schizophrenia, different forms of depression, neurodegenerative disorders, sexual  
dysfunctions, cocaine, alcohol, opiate and nicotine addiction, in addition to glaucoma, cognitive disorders, restless leg syndrome, hy-  
peractivity syndrome (ADHS), hyperprolactinemia, hyperprolactinoma, locomotion disorders associated with Parkinson's disease,  
treatment of L-DOPA and neuroleptic-induced locomotion disorders, for example, akathisia, rigor, dystonia and dyskinesia, wherein  
the substituents are defined in the description.

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]



MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT,  
RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR,  
TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG,  
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— mit internationalen Recherchenbericht

(84) Bestimmungsstaaten (*regional*): ARIPO-Patent (GH,  
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),  
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,  
TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE,  
DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL,

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-  
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Co-  
des and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der  
PCT-Gazette verwiesen.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft neurorezeptoraktive N-[(4-Phenyl-1-piperazinyl)alkyl]-substituierte Heteroarencarboxamide der allgemeinen Formel (I) sowie strukturanaloge 2-Ferrocenylverbindungen der allgemeinen Formel (II) und ihre Verwendung zur Behandlung von ZNS-Erkrankungen, wie beispielsweise Schizophrenie, verschiedene Arten der Depression, neurodegenerative Störungen, sexuelle Dysfunktionen, Kokain-, Alkohol-, Opiat- und Nikotinsucht, sowie von Glaukoma, kognitiven Störungen, Restless Leg Syndrom, Hyperaktivitätssyndrom (ADHS), Hyperprolaktinämie, Hyperprolaktinom, Parkinson-assoziierten Bewegungsstörungen, Behandlung von L-DOPA und Neuroleptika-induzierten Bewegungsstörungen, z.B. Akathisie, Rigor, Dystonie und Dyskinesien, worin die Substituenten wie in der Beschreibung definiert sind.